

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

File copy

51

Int. Cl. 2:

C 07 D 239/34

A 01 N 5/00

19 BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

DEUTSCHES



PATENTAMT

DE 27 34 827 A 1

Behördenvermerk

11

21

22

43

Offenlegungsschrift 27 34 827

Aktenzeichen:

P 27 34 827.2

Anmeldetag:

2. 8. 77

Offenlegungstag:

9. 2. 78

31

Unionspriorität:

32 33 31

2. 8. 76 Großbritannien 32084-76

54

Bezeichnung:

Verfahren zum Hemmen des Wachstums von unerwünschten Pflanzen

71

Anmelder:

Imperial Chemical Industries Ltd., London

74

Vertreter:

Fincke, H., Dr.-Ing.; Bohr, H., Dipl.-Ing.; Staeger, S., Dipl.-Ing.;
Kneißl, R., Dr.rer.nat.; Pat.-Anwälte, 8000 München

72

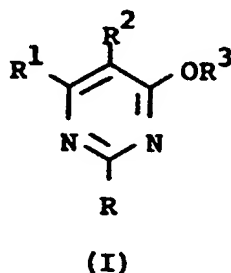
Erfinder:

Sunley, Raymond Leo, Twyford; Lewis, Terence, Bracknell; Berkshire;
Pemberton, Dennis, Manchester, Lancashire (Großbritannien)

DE 27 34 827 A 1

P a t e n t a n s p r ü c h e

1. Verfahren zum Hemmen des Wachstums von unerwünschten Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf die Pflanzen oder deren Wachstumsmedium eine herbizid wirkende Menge einer Pyrimidinverbindung der allgemeinen Formel I:



worin R für (a) ein Wasserstoffatom, (b) ein Phenylradikal, das gegebenenfalls durch eine oder mehrere Alkyl- oder Alkoxygruppen oder Fluor-, Chlor- oder Bromatome substituiert ist, oder (c) ein Alkyl- oder Alkenylradikal steht, welches gegebenenfalls durch ein oder mehrere der folgenden Atome bzw. Gruppen substituiert ist:

ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom;

ein Cycloalkyl-, Hydroxy-, Alkylthio-, Furyl-, Pyridyl- oder Mono- oder Dialkylaminoradikal;

ein Phenylradikal, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Fluor-, Chlor- oder Bromatome oder Alkyl-, Phenyl-, Cyano-, Halogenalkyl- oder Alkoxyradikale substituiert ist;

oder ein Alkoxyradikal, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Phenyl- oder Alkoxyradikale substituiert ist;

R¹ für ein Niedrigalkylradikal steht;

R² für ein Wasserstoffatom oder ein Niedrigalkylradikal steht
und

R^3 für ein Alkyl- oder Alkenylradikal steht, das gegebenenfalls durch eine oder mehrere der folgenden Gruppen substituiert ist: Cycloalkyl, Pyridyl, Naphthyl oder Phenyl, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome oder Halogenalkyl, Cyano-, Alkyl-, Hydroxymethyl- oder 4-Methyl-2-propyl-6-pyrimidin-yloxymethylradikale substituiert ist,

oder ein Säureadditionssalz davon aufbringt.

2. Verfahren nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die Gruppe R für ein Alkylradikal mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, ein Benzylradikal oder ein Cyclohexylmethylradikal steht.

3. Verfahren nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß die Gruppe R^1 für ein Methylradikal steht.

4. Verfahren nach einem der vorstehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Gruppe R^2 für ein Wasserstoffatom steht.

5. Verfahren nach einem der vorstehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Gruppe R^3 für ein Alkyl- oder Alkenylradikal mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht.

6. Verfahren nach einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß die Gruppe R^3 für ein Benzylradikal steht, das gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom oder Jod substituiert ist.

7. Verfahren nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man bei dem Verfahren eine Verbindung

verwendet, bei der R für ein Propyl- oder Allylradikal steht, R^1 für eine Methylgruppe steht, R^2 für ein Wasserstoffatom steht und R^3 für ein Cyclohexylmethylradikal oder ein Benzylradikal, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome substituiert ist, steht.

8. Verfahren nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man bei dem Verfahren eine Verbindung verwendet, bei der die Gruppe R für ein Benzylradikal steht, das gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom oder Jod substituiert ist, R^1 für ein Methylradikal steht, R^2 für ein Wasserstoffatom steht und R^3 für ein Propyl- oder Isobutylradikal steht.

9. Verfahren nach einem der vorstehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pyrimidinverbindung in einer Menge von 1 bis 10 kg pro ha anwendet.

10. Verfahren zum selektiven Hemmen des Wachstums von Unkräutern in Nutzpflanzen von Sojabohnenpflanzen, Erdnußpflanzen, Baumwolle, Weizen, Gerste und Reis, dadurch gekennzeichnet, daß man auf den Nutzpflanzenbereich vor dem Erscheinen der Nutzpflanze eine Verbindung der Formel I nach einem der Ansprüche 1 bis 9 in einer zur Hemmung des Wachstums der Unkräuter ausreichenden Menge, jedoch in einer Menge, die nicht dazu ausreicht, die Nutzpflanzen wesentlich zu beschädigen, aufbringt.

11. Verfahren nach Anspruch 10, dadurch gekennzeichnet, daß die Aufbringungsmenge der Pyrimidinverbindung 1 bis 4 kg pro ha beträgt.

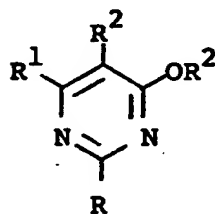
12. Herbizide Zusammensetzungen, dadurch gekennzeichnet, daß sie als Wirkstoff eine Verbindung der

2734827

Formel I nach einem der Ansprüche 1 bis 9 in Gemisch mit einem ersten Verdünnungsmittel oder einem flüssigen Verdünnungsmittel, das ein oberflächenaktives Mittel enthält, enthält.

13. Herbizide Zusammensetzungen nach Anspruch 12, dadurch gekennzeichnet, daß sie 0,01 bis 85 Gew.-% Wirkstoff enthalten.

14. Herbizide Pyrimidinverbindungen mit der allgemeinen Formel:



(I)

worin R für (a) ein Wasserstoffatom, (b) ein Phenylradikal, das gegebenenfalls durch eine oder mehrere Alkyl- oder Alkoxygruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder durch Fluor-, Chlor- oder Bromatome substituiert ist, oder (c) ein Alkyl- oder Alkenylradikal mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen steht das gegebenenfalls durch ein oder mehrere der folgenden Atome bzw. Gruppen substituiert ist:

in Fluor-, Chlor- oder Bromatom;
eine Cycloalkylgruppe mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, eine Hydroxygruppe, eine Alkylthiogruppe mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen,
in Furyl- oder Pyridylradikal, ein Mono- oder Dialkylaminoradikal, bei dem das eine oder die zwei Alkylradikale jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten, ein Phenylradikal, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Alkyl-, Halogenalkyl- oder Alkoxy-

radikale jeweils mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder durch Fluor, Chlor, Brom, Phenyl oder Cyano substituiert ist, oder ein Alkoxyradikal mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Phenylradikale oder Alkoxyradikale mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen substituiert ist;

R^1 für ein Alkylradikal mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen steht;

R^2 für ein Wasserstoffatom oder ein Alkylradikal mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht; und

R^3 für ein Alkyl- oder Alkenylradikal mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen steht, das gegebenenfalls durch eine oder mehrere der folgenden Gruppen substituiert ist:

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, Pyridyl, Naphthyl, oder Phenyl, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome, Halogenalkyl-, oder Alkylradikale jeweils mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cyano-, Hydroxymethyl-, oder 4-Methyl-2-propyl-6-pyrimidinylloxymethylradikale substituiert ist, mit der Maßgabe, daß, wenn R für Wasserstoff oder Methyl steht, R^3 nicht für ein Alkylradikal mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder ein Benzylradikal steht,

sowie die Säureadditionssalze davon.

15. Herbizide Pyrimidinverbindungen nach Anspruch 14, dadurch gekennzeichnet, daß R für ein Propyl- oder Allylradikal steht, R^1 für eine Methylgruppe steht, R^2 für ein Wasserstoffatom steht und R^3 für ein Cyclohexylmethylradikal oder ein Benzylradikal, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome substituiert ist, steht.

16. Herbizide Pyrimidinverbindungen nach Anspruch 14, dadurch gekennzeichnet, daß R für ein Benzylradikal, das gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom oder Jod substituiert ist, steht, R^1 für ein Methylradikal steht, R^2 für ein Wasserstoffatom steht und R^3 für ein Propyl- oder Isobutylradikal steht.

PATENTANWALT
DR.-ING. R. FRIEKE
DIPLOM-ING. R. FRIEKE
DIPLOM-ING. S. FRIEKE
DR. phil. nat. R. FRIESSL
MÜLLERSTRASSE 31
8000 MÜNCHEN 5

6

2. AUG 1977
2734827

Mappe 24 302
ICI Case Nr. PP 28976

IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES LIMITED, London / England

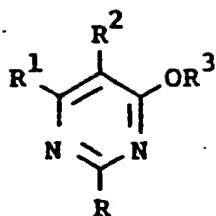
Verfahren zum Hemmen des Wachstums von unerwünschten Pflanzen

Priorität England Nr. 32084/76 vom 2.8.1976

Die Erfindung betrifft ein Verfahren zum Hemmen des Wachstums von unerwünschten Pflanzen. Die Erfindung betrifft weiterhin Zusammensetzungen, welche bestimmte Pyrimidinverbindungen als Wirkstoffe enthalten, und bestimmte neue Pyrimidinverbindungen.

Durch die Erfindung wird ein Verfahren zum Hemmen des Wachstums von unerwünschten Pflanzen zur Verfügung gestellt, das dadurch gekennzeichnet ist, daß man auf die Pflanzen oder deren Wachstumsmedium eine herbizid wirksame Menge einer Pyrimidinverbindung der allgemeinen Formel I:

709886/0875



(I)

worin R für (a) ein Wasserstoffatom, (b) ein Phenylradikal, das gegebenenfalls durch eine oder mehrere Alkyl- oder Alkoxygruppen oder Fluor-, Chlor- oder Bromatome substituiert ist, oder (c) ein Alkyl- oder Alkenylradikal steht, welches gegebenenfalls durch ein oder mehrere der folgenden Atome bzw. Gruppen substituiert ist:

ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom;

ein Cycloalkyl-, Hydroxy-, Alkylthio-, Furyl-, Pyridyl- oder Mono- oder Dialkylaminoradikal;

ein Phenylradikal, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Fluor-, Chlor- oder Bromatome oder Alkyl-, Phenyl-, Cyano-, Halogenalkyl- oder Alkoxyradikale substituiert ist;

oder ein Alkoxyradikal, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Phenyl- oder Alkoxyradikale substituiert ist;

R¹ für ein Niedrigalkylradikal steht;

R² für ein Wasserstoffatom oder ein Niedrigalkylradikal steht und

R³ für ein Alkyl- oder Alkenylradikal steht, das gegebenenfalls durch eine oder mehrere der folgenden Gruppen substituiert ist:

Cycloalkyl, Pyridyl, Naphthyl oder Phenyl, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome oder Halogenalkyl-, Cyano-, Alkyl-, Hydroxymethyl- oder 4-Methyl-2-propyl-6-pyrimidin-yl xym thylradikale substituiert ist,

od r in Säureadditionssalz davon aufbringt.

Wenn R für ein Phenylradikal steht, das durch ein Alkyl- oder Alkoxyradikal substituiert ist, dann können die Alkyl- oder Alkoxyradikale jeweils beispielsweise 1 bis 4 Kohlenstoffatome haben. Wenn R für ein Alkylradikal steht, dann kann es z.B. 1 bis 12 oder mehr Kohlenstoffatome enthalten. Wenn R ein Alkylradikal ist, dann enthält es vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome. So kann es z.B. ein Methyl-, Äthyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, Isobutyl-, Amyl- oder Hexylradikal sein.

Wenn R ein Alkylradikal ist, das durch ein Cycloalkyl-, Alkylthio-, Monoalkylamino- oder Dialkylaminoradikal substituiert ist, dann kann das Cycloalkylradikal z.B. 3 bis 6 Kohlenstoffatome, das Alkylthioradikal 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die Alkylgruppe oder die Alkylgruppen in den Mono- und Dialkylaminoradikale können jeweils z.B. 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten. Wenn R für ein Phenylradikal steht, das durch eine Alkyl-, Alkoxy- oder Halogenalkylgruppe substituiert ist, dann können diese Gruppen jeweils z.B. 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten. Die Halogenalkylgruppe kann z.B. eine Trifluormethylgruppe sein. Wenn R für ein Alkylradikal steht, das durch ein Alkoxyradikal substituiert ist, welches seinerseits ebenfalls durch ein Alkoxyradikal substituiert ist, dann kann jedes Alkoxyradikal z.B. 1 bis 6 Kohlenstoffatome haben. Wenn R ein Alkenylradikal ist, dann kann es z.B. bis zu 6 oder mehr Kohlenstoffatome enthalten. Einzelbeispiele für Alkenylradikale innerhalb dieses Bereiches sind Allyl- und Crotylradikale. Beispiele für substituierte Alkenylradikale sind das α -trifluorierte Propenylradikal ($\text{CF}_3\text{CH}=\text{CH}-$), das Styryl- (d.h. Phenylvinyl-) Radikal ($\text{PhCH}=\text{CH}-$) und das Furylvinylradikal.

Vorzugsweise hat das Niedrigalkylradikal R^1 nicht mehr als 3 Kohlenstoffatome. Mehr bevorzugt steht R^1 für eine Methylgruppe.

Wenn R^2 für ein Niedrigalkylradikal steht, dann hat es vorzugsweise nicht mehr als 4 Kohlenstoffatome.

Die Gruppe R^3 kann z.B. bis zu 8 oder mehr Kohlenstoffatome enthalten. Beispiele für Alkylradikale, die in diesen Bereich fallen, sind z.B. Äthyl, Propyl, Isopropyl, Butyl, Isobutyl, Amyl, Isoamyl, 2-Methylbutyl und 2-Äthylbutyl. Ein bevorzugtes Alkylradikal ist Isobutyl. Beispiele für Alkenylradikale sind Allyl- und Crotylradikale.


Wenn R^3 ein Alkylradikal ist, das durch ein Cycloalkylradikal substituiert ist, dann kann das Cycloalkylradikal z.B. 3 bis 6 Kohlenstoffatome haben. R^3 kann z.B. ein Cyclohexylmethylradikal sein. Wenn R^3 für ein Alkylradikal steht, das durch ein alkyl- oder halogenalkylsubstituiertes Phenylradikal substituiert ist, dann kann der Alkyl- oder Halogenalkylsubstituent 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten. R^3 kann z.B. ein Benzylradikal sein, dessen Phenylring gegebenenfalls durch ein oder mehrere Fluor-, Chlor-, Brom-, Jod-, Halogenalkyl- oder Cyanoradikale substituiert sein kann.

Untergruppen von Verbindungen, die unter die breite Klasse von Verbindungen fallen, die für das erfindungsgemäße Verfahren geeignet sind, sind solche, bei denen R für ein Propyl- oder Allylradikal steht, R^1 für eine Methylgruppe steht, R^2 für ein Wasserstoffatom steht und R^3 für eine Cyclohexylmethylgruppe oder eine Benzylgruppe, die gegebenenfalls wie oben angegeben substituiert ist, steht. Eine weitere Untergruppe enthält solche Verbindungen, bei denen R für ein Benzylradikal, das gegebenenfalls wie oben angegeben substituiert ist, steht, R^1 für eine Methylgruppe steht, R^2 für ein Wasserstoffatom steht und R^3 für ein Propyl-, Isobutyl- oder Butylradikal steht.


Die Identität d r Säur , die zur Bildung der Säureadditionssalze der erfindungsgemäßen Verbindungen verwendet wird, ist nicht kritisch. Es kann eine weite Vielzahl von Säureadditionssalzen der jeweiligen Verbindung verwendet werden. Aus Gründen der Einfachheit und der Wirtschaftlichkeit werden jedoch Salze bevorzugt, die sich von ohne weiteres verfügbaren Mineralsäuren ableiten, obgleich auch andere gewünschtenfalls verwendet werden können. Bei der Auswahl der Säure wird der Zweck berücksichtigt, für den das Salz verwendet werden soll. Salze, die aus herbiziden Säuren gebildet worden sind, die in der Erde hochbeständig sind, sind offensichtlich nicht für Anwendungszwecke geeignet, bei denen die Nutzpflanzen kurz nach Aufbringung des Herbizids eingepflanzt werden sollen. Einzelbeispiele für Säuren, die zur Bildung der Säureadditionssalze verwendet werden können, sind Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Salpetersäure und Phosphorsäure.

Einzelbeispiele von Verbindungen, die für die Zwecke der Erfindung geeignet sind, sind zusammen mit einer charakteristischen physikalischen Konstante in der nachfolgenden Tabelle I zusammengestellt.

Fortsetzung Tabelle I

11	CH ₃	H	$\text{isoc}_5\text{H}_{11}$	1.4735 (23)
12	CH ₃	H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{CH}_3$	Kp 130-135°C/0.15 Torr
13	CH ₃	H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$	Kp 180-182°C/15 Torr
14	CH ₃	H	$-\text{CH}_2-$ 	1.5532 (21)
15	CH ₃	H	$-\text{CH}_2\text{Ph}$	1.5342 (21)
16	CH ₃	H	2-Fluorobenzyl	Fp 92.5-95°C
17	CH ₃	H	2-Cyanobenzyl	Kp 135°C/0.07 Torr
18	CH ₃	H	2-Chlorobenzyl	
19	CH ₃	H	2-Methylbenzyl	
20	C ₂ H ₅	H	C ₄ H ₉	1.4755 (25)

Fortsetzung Tabelle I

21	C_2H_5	CH_3	H	$-CH_2CH(C_2H_5)_2$	1.4708 (21)
22	C_3H_7	CH_3	H	C_3H_7	1.4800 (28)
23	C_3H_7	CH_3	H	C_4H_9	1.4758 (28)
24	C_3H_7	CH_3	H	$18OC_4H_9$	1.4708 (32)
25	C_3H_7	CH_3	H	$-CH_2CH(C_2H_5)CH_3$	1.4765 (21)
26	C_3H_7	CH_3	H	$18OC_5H_{11}$	1.4737 (26)
27	C_3H_7	CH_3	H	$-CH_2CH(C_2H_5)_2$	1.4739 (26)
28	C_3H_7	CH_3	H	$-CH_2-$ 	1.4990 (21)
29	C_3H_7	CH_3	H	$-CH_2Ph$	1.5353 (29)
30	C_3H_7	CH_3	H	4-Chlorobenzyl	1.5450 (19)
31	C_3H_7	CH_3	H	2-Chlorobenzyl	1.5487 (29)
32	C_3H_7	CH_3	H	2-Bromobenzyl	1.5610 (20)

- 9 -

Fortsetzung Tabelle I

33	C ₃ H ₇	CH ₃	H	2-Jodobenzyl	1.5874 (22)
34	C ₃ H ₇	CH ₃	H	4-Fluorobenzyl	1.5228 (21)
35	C ₃ H ₇	CH ₃	H	2-Fluorobenzyl	1.5289 (20)
36	C ₃ H ₇	CH ₃	H	3-Fluorobenzyl	1.5239 (21)
37	C ₃ H ₇	CH ₃	H	2-CF ₃ -benzyl	1.4996 (21)
38	C ₃ H ₇	CH ₃	H	2,6-Dichloro- benzyl	1.5582 (21)
39	C ₃ H ₇	CH ₃	H	3,4-Dichloro- benzyl	1.5569 (19)
40	C ₃ H ₇	CH ₃	H	3-Pyridylmethyl	1.5408 (20)
41	C ₃ H ₇	CH ₃	H	2-Pyridylmethyl	1.5384 (20)
42	C ₃ H ₇	CH ₃	H	1-Naphthyl- methyl	1.5949 (20)

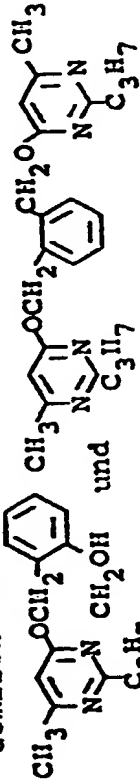

709886/0875

14


2734827

Fortsetzung Tabelle I


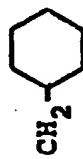
R R' R² R³

43	Gemisch aus 	CH ₃ und C ₃ H ₇	CH ₃	H	18OC ₄ H ₉ 	1.5550 (20) 1.4730 (18) 1.4970 (20) 1.5320 (18) 1.5458 (20) 1.5368 (22) 1.4745 (25) 1.4748 (21) 1.4952 (21)
44	18OC ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	18OC ₄ H ₉	
45	18OC ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ -Ph 2-Chlorobenzyl 2-Methylbenzyl	
46	18OC ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	C ₄ H ₉ 18OC ₄ H ₉	
47	18OC ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	C ₄ H ₉	
48	18OC ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	C ₄ H ₉	
49	C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	H	C ₄ H ₉	
50	C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	H	C ₄ H ₉	
51	C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	H	C ₄ H ₉	

Fortsetzung Tabelle I

52	C_4H_9	CH_3	H	CH_2Ph	1.5340(21)
53	C_4H_9	CH_3	H	2-Chlorobenzyl	1.5441(21)
54	C_4H_9	CH_3	H	2-Methylbenzyl	1.5336(22)
55	$isoc_4H_9$	CH_3	H	C_3H_7	1.4760(20)
56	$isoc_4H_9$	CH_3	H	$isoc_4H_9$	1.4728(21)
57	$isoc_4H_9$	CH_3	H	$-CH_2CH(C_2H_5)CH_3$	1.4750(20)
58	C_5H_{11}	CH_3	H	C_3H_7	1.4770(19)
59	C_5H_{11}	CH_3	H	C_4H_9	1.4782(19)
60	C_5H_{11}	CH_3	H	$isoc_4H_9$	1.4767(19)
61	C_5H_{11}	CH_3	H	$-CH_2CH(C_2H_5)CH_3$	1.4785(20)
62	C_5H_{11}	CH_3	H	CH_2- 	1.4953(20)

Fortsetzung Tabelle I

63	C ₅ H ₁₁	CH ₃	H	CH ₂ Ph	1.5290 (20)
64		CH ₃	H	-CH ₂ CH(CH ₃)C ₂ H ₅	1.4941 (21)
65	CH ₂ OH	CH ₃	H	<u>iso</u> C ₄ H ₉	Kp 120°C/0.15 Torr
66	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	H	<u>iso</u> C ₄ H ₉	1.4755 (24)
67	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₂ Ph	1.5363 (24)
68	CH ₂ OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	C ₃ H ₇	1.4740 (21)
69	CH ₂ OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	<u>iso</u> C ₄ H ₉	1.4709 (22)
70	CH ₂ OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	-CH ₂ CH(CH ₃)C ₂ H ₅	1.4745 (21)
71	CH ₂ OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		1.4920 (21)
72	CH ₂ OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	CH ₂ Ph	1.5230 (22)
73	CH ₂ OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	2-chlorobenzyl	1.5367 (22)

709886/0875

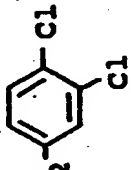
2734827

Fortsetzung Tabelle I

74	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	H	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	Kp 140°C/0.55 Torr
75	$\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$	CH_3	H	isoC_4H_9	Kp 117°C/0.5 Torr
76	$\begin{array}{c} \text{-CHOC}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	CH_3	H	2-Chlorobenzyl	Kp 158°C/0.75 Torr
77	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$	CH_3	H	CH_2Ph	Kp 190°C/0.1 Torr
78	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CHC}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	CH_3	H	2-Chlorobenzyl	Kp 165°C/0.5 Torr
79	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}_5\text{H}_{11}$	CH_3	H	isoC_4H_9	Kp 128°C/0.2 Torr
80	$(\text{CH}_2)_5\text{OC}_6\text{H}_{13}$	CH_3	H	isoC_4H_9	Kp 152°C/0.2 Torr
81	$\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$	CH_3	H	CH_2Ph	Kp 150°C/0.5 Torr
82	$\text{CH}_2\text{OC}_4\text{H}_9$	CH_3	H	isoC_4H_9	Kp 103°C/0.4 Torr
83	$\text{CH}_2\text{OC}_4\text{H}_9$	CH_3	H	CH_2Ph	Kp 114°C/0.4 Torr
84	$\text{CH}_2\text{SC}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	H	isoC_4H_9	Kp 102°C/0.15 Torr

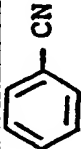

709886/0875

Fortsetzung Tabelle I

					Kp 154°C/0.15 Torr
85	$\text{CH}_2\text{SC}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	H	CH_2Ph	1.5195 (20)
86	CCl_3	CH_3	H	C_3H_7	1.5108 (25)
87	CCl_3	CH_3	H	isoc_4H_9	1.5040 (22)
88	CCl_3	CH_3	H	$\text{CH}_2\text{CHC}_2\text{H}_5$ $\quad\quad\quad\text{CH}_3$	
89	CF_3	CH_3	H	CH_2Ph	1.5010 (19)
90	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$	CH_3	H	CH_2Ph	1.5003 (20)
91	$\text{CH}=\text{CHCF}_3$	CH_3	H	CH_2Ph	1.5314 (18)
92	$\text{CH}=\text{CHCF}_3$	CH_3	H	isoc_4H_9	1.4561 (16)
93	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	CH_3	H	CH_2Ph	1.5787 (20)
94	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	CH_3	H	isoc_4H_9	1.5272 (22)
95	CH_2CH_2 - 	CH_3	H	isoc_4H_9	1.5434 (21)

709886/0875

Fortsetzung Tabelle I

96	CH_2CH_2 - 	CH_3	H	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{H}_5$	1.5341 (21)
97	Ph	CH_3	H	isoc_4H_9	1.5562 (19)
98	4-Chlorophenyl	CH_3	H	CH_2Ph	Fp 100-102°C
99	4-Chlorophenyl	CH_3	H	isoc_4H_9	Fp 72.5-73.5°C
100	3-Methoxyphenyl	CH_3	H	isoc_4H_9	1.5608 (22)
101	CH_2Ph	CH_3	H	C_3H_7	1.5380 (18)
102	CH_2Ph	CH_3	H	isoc_4H_9	1.5325 (19)
103	CH_2Ph	CH_3	H		1.5440 (18)
104	CH_2Ph	CH_3	H	CH_2Ph	Fp 75-77°C
105	CH_2Ph	CH_3	H	2-Chlorobenzyl	1.5918 (17)

709886/0875


Fortsetzung Tabelle I

106	3-Methylbenzyl	CH ₃	H	<u>isoc</u> ₄ H ₉	1.5298 (21)
107	4-Chlorobenzyl	CH ₃	H	<u>isoc</u> ₄ H ₉	1.5397 (20)
108	4-Chlorobenzyl	CH ₃	H	CH ₂ Ph	1.5876 (21)
109	4-Phenylbenzyl	CH ₃	H	<u>isoc</u> ₄ H ₉	1.5814 (21)
110	4-Methoxybenzyl	CH ₃	H	-CH ₂ CH=CH ₂	1.5538 (21)
111	4-Methoxybenzyl	CH ₃	H	<u>isoc</u> ₄ H ₉	1.5355 (21)
112	4-Methoxybenzyl	CH ₃	H	CH ₂ Ph	1.5812 (21)
113	2-Methylbenzyl	CH ₃	H	<u>isoc</u> ₄ H ₉	1.5320 (21)
114	3-CF ₃ -benzyl	CH ₃	H	<u>isoc</u> ₄ H ₉	1.4892 (25)
115	-CHBr-Ph	CH ₃	H	<u>isoc</u> ₄ H ₉	FP 43-45°C
116	-CH-Ph NHC ₃ H ₇	CH ₃	H	<u>isoc</u> ₄ H ₉	1.5260 (21)

709886/0875

- 24 -

Fortsetzung Tabelle I

117	CH=CH-Ph	CH ₃	H	CH ₂ Ph	Fp 88-91°C
118	CH=CH-Ph	CH ₃	H	<u>isoc</u> ₄ H ₉	Fp 35-37°C
119	CH=CH- 	CH ₃	H	<u>isoc</u> ₄ H ₉	1.5979 (19)

Fußnoten:

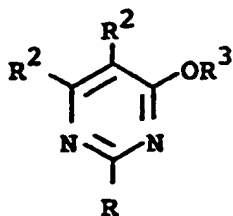
In der vorstehenden Tabelle bedeutet die Abkürzung Kp den Siedepunkt und die Abkürzung Fp den Schmelzpunkt.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen sind Herbizide, die gegenüber einem Bereich von Grasarten und Arten von zweikeimblättrigen Pflanzen phytotoxisch sind. Sie sind im allgemeinen bei einer Vorlaufanwendung aktiver als bei einer Nachlaufanwendung. Das bedeutet, daß sie im allgemeinen wirksamer sind, wenn sie auf die Erde aufgebracht werden, um das Wachstum der Pflanzen aus den Samen oder den Sämlingen, die in der Erde vorhanden sind, zu verhindern, als wenn sie auf die oberhalb der Erde gelegenen Teile der wachsenden Pflanzen aufgebracht werden. Die Aufbringungsrate der Verbindungen variiert entsprechend einer Vielzahl von Faktoren, beispielsweise der jeweiligen zur Verwendung ausgewählten Verbindung und der Art der Pflanzen, deren Wachstum gehemmt werden soll. Als allgemeine Angabe kann jedoch festgestellt werden, daß eine Aufbringungsrate im Bereich von 1 bis 10 kg pro ha gewöhnlich geeignet ist.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen haben sich gegenüber Grasunkräutern und bestimmten zweikeimblättrigen Unkräutern bei Aufbringungsraten als stark phytotoxisch erwiesen, die bestimmten Nutzpflanzen, insbesondere Sojabohnenpflanzen, Erdnußpflanzen, Baumwolle, Weizen, Gerste und Reis, keine wesentlichen Schädigungen zufügen. Durch die Erfindung wird daher weiterhin ein Verfahren zur selektiven Hemmung des Wachstums von Unkräutern in Nutzpflanzen von Sojabohnenpflanzen, Erdnußpflanzen, Baumwolle, Weizen, Gerste und Reis zur Verfügung gestellt, das dadurch gekennzeichnet ist, daß man auf den Nutzpflanzenbereich vor dem Erscheinen der Nutzpflanze eine Verbindung der Formel I oder ein Säureadditionssalz davon, wie vorstehend definiert, in einer zur Hemmung des Wachstums der Unkräuter ausreichenden Menge, jedoch in einer Menge, die nicht dazu ausreicht, die Nutzpflanzen wesentlich zu beschädigen, aufbringt.

Die Menge, in der die Verbindung aufgebracht wird, hängt von der Art der Nutzpflanze und der jeweils ausgewählten Verbindung ab. Im allgemeinen ist eine Menge von 1 bis 4 kg pro ha geeignet.

Die erfindungsgemäß verwendeten Verbindungen werden vorzugsweise in Form einer Zusammensetzung aufgebracht, in der der Wirkstoff mit einem Verdünnungsmittel oder Träger vermischt ist. Durch die Erfindung wird daher weiterhin eine herbizide Zusammensetzung zur Verfügung gestellt, die dadurch gekennzeichnet ist, daß sie als Wirkstoff eine Pyrimidinverbindung der Formel:



worin R, R¹, R² und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben, im Gemisch mit einem festen Verdünnungsmittel oder einem flüssigen Verdünnungsmittel, das ein oberflächenaktives Mittel enthält, enthält.

Die erfindungsgemäßen festen Zusammensetzungen können beispielsweise in Form von verstäubbaren Pulvern oder in Form von Granulaten vorliegen. Geeignete feste Verdünnungsmittel sind z.B. Kaolin, Bentonit, Kieselgur, Dolomit, Calciumcarbonat, Talk, gepulvertes Magnesiumoxid und Fuller's Erde.

Feste Zusammensetzungen können auch die Form von dispergierbaren Pulvern oder Granulaten haben, die zusätzlich zu dem Wirkstoff ein Befeuchtungsmittel enthalten, um die Dispergierung des Pulvers oder des Granulats in Flüssigkeiten zu erleichtern. Solche Pulver oder Granulate können Füllstoffe, Suspendierungsmittel und dergleichen enthalten.

Flüssige Zusammensetzungen sind z.B. wäßrige Lösungen, Dispersionen und Emulsionen, die den Wirkstoff vorzugsweise in Gegen-

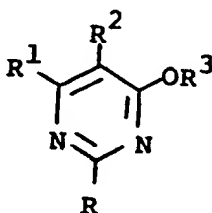
wart von einem oder mehreren oberflächenaktiven Mitteln enthalten. Wasser oder organische Flüssigkeiten können dazu verwendet werden, um die Lösungen, Dispersionen oder Emulsionen des Wirkstoffes herzustellen. Die flüssigen Zusammensetzungen gemäß der Erfindung können auch einen oder mehrere Korrosionsinhibitoren, z.B. Laurylisochinoliniumbromid, enthalten.

Oberflächenaktive Mittel können vom kationischen, anionischen oder nicht-ionogenen Typ sein. Geeignete Mittel des kationischen Typs sind z.B. quaternäre Ammoniumverbindungen, wie Cetyltrimethylammoniumbromid. Geeignete Mittel des anionischen Typs sind z.B. Seifen, Salze von aliphatischen Monoestern der Schwefelsäure, wie Natriumlaurylsulfat, und Salze von sulfonierten aromatischen Verbindungen, wie Dodecylbenzolsulfonat, Natrium-, Calcium- und Ammoniumlignosulfonat, Butyl-naphthalinsulfonat und Gemische der Natriumsalze von Diisopropyl- und Triisopropyl-naphthalinsulfonsäure. Geeignete Mittel des nicht-ionogenen Typs sind z.B. die Kondensationsprodukte von Äthylenoxid mit Fettalkoholen, wie Oleylalkohol und Cetylalkohol, oder mit Alkylphenolen, wie Octylphenol, Nonylphenyl und Octylcresol. Andere geeignete nicht-ionogene Mittel sind die Halbester, die sich von langkettigen Fettsäuren und Hexitanhydriden ableiten, z.B. Sorbitmonolaurat, die Kondensationsprodukte dieser Halbester mit Äthylenoxid und die Lecithine.

Die Zusammensetzungen, die in Form von wässrigen Lösungen, Dispersionen oder Emulsionen verwendet werden sollen, werden im allgemeinen in Form eines Konzentrats vertrieben, das einen hohen Gehalt des Wirkstoffs aufweist. Dieses Konzentrat wird vor dem Gebrauch mit Wasser verdünnt. Solche Konzentrate müssen normalerweise über verlängerte Zeiträume lagerungsbeständig sein. Nach der Lagerung müssen sie mit Wasser verdünnbar sein, um wässrige Zubereitungen zu bilden, die über einen genügenden Zeitraum homogen verbleiben, daß sie durch herkömmlich Spritzein-

richtungen aufgebracht werden können. Im allg meinen können die Konzentrate geeigneterweise 10 bis 85 und vorzugsweise 25 bis 60 Gew.-% Wirkstoff enthalten. Verdünnte Zubereitungen, die für den Gebrauch fertig sind, können variierende Mengen des Wirkstoffs je nach dem Anwendungszweck enthalten. Verdünnte Zubereitungen, die für viele Anwendungszwecke geeignet sind, enthalten jedoch 0,01 bis 10,0 Gew.-%, vorzugsweise 0,1 bis 1 Gew.-%, Wirkstoff.

Durch die Erfindung werden weiterhin neue Pyrimidinverbindungen mit herbiziden Eigenschaften der Formel:



(I)

worin R für (a) ein Wasserstoffatom, (b) ein Phenylradikal, das gegebenenfalls durch eine oder mehrere Alkyl- oder Alkoxygruppen oder Fluor-, Chlor- oder Bromatome substituiert ist, oder (c) ein Alkyl- oder Alkenylradikal steht, welches gegebenenfalls durch ein oder mehrere der folgenden Atome bzw. Gruppen substituiert ist:

ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom;

ein Cycloalkyl-, Hydroxy-, Alkylthio-, Furyl-, Pyridyl- oder Mono- oder Dialkylaminoradikal;

ein Phenylradikal, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Fluor-, Chlor- oder Bromatome oder Alkyl-, Phenyl-, Cyano-, Halogenalkyl- oder Alkoxyradikale substituiert ist;

oder ein Alkoxyradikal, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Phenyl- oder Alkoxyradikale substituiert ist;

R¹ für ein Niedrigalkylradikal steht;

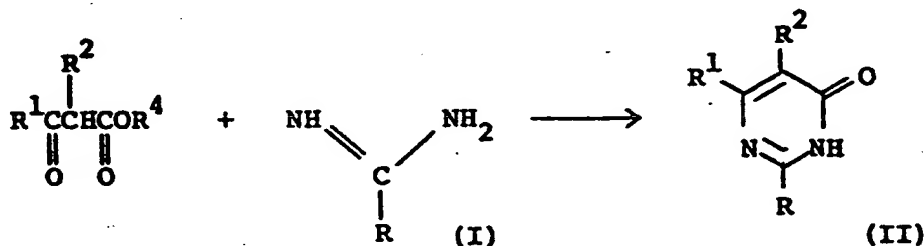
R² für ein Wasserstoffatom oder ein Niedrigalkylradikal steht
und

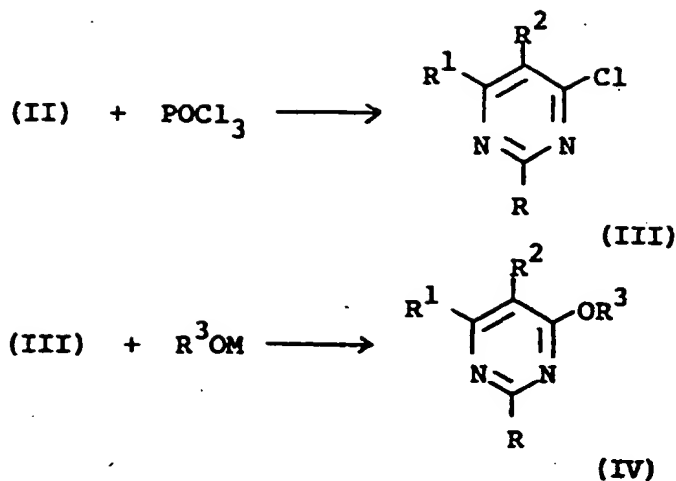
R³ für ein Alkyl- oder Alkenylradikal steht, das gegebenenfalls durch eine oder mehrere der folgenden Gruppen substituiert ist;

Cycloalkyl, Pyridyl, Naphthyl oder Phenyl, das gegebenenfalls durch ein oder mehrere Fluor-, Chlor-, Brom- oder Jodatome oder Halogenalkyl-, Cyano-, Alkyl-, Hydroxymethyl- oder 4-Methyl-2-propyl-6-pyrimidin-yloxymethylradikale substituiert ist, mit der Maßgabe, daß, wenn R für Wasserstoff oder Methyl steht, R³ nicht für ein Alkylradikal mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder ein Benzylradikal steht, sowie Säureadditionssalze davon zur Verfügung gestellt.

Die erfindungsgemäß verwendeten Verbindungen können durch an sich bekannte Verfahren hergestellt werden. Somit können sie nach dem Verfahren hergestellt werden, das unten in Schema A dargestellt ist:

Schema A:





In dem Schema A haben die Symbole R, R¹, R² und R³ beliebige der oben angegebenen Bedeutungen. R⁴ steht für eine Hydrocarbylgruppe, vorzugsweise eine Niedrigalkylgruppe, wie eine Alkylgruppe mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. M steht für ein Alkalimetall, z.B. Natrium oder Kalium. Bei dem im Schema A dargestellten Verfahren wird ein Acylessigester $\text{RCCH}_2\text{COR}^4$ mit einem

Amidinderivat I umgesetzt. Das Amidinderivat wird normalerweise als Säureadditionssalz, z.B. als Hydrochlorid, erhalten. Zur Umsetzung mit dem Acylessigester wird die Amidinbase aus ihrem Säureadditionssalz freigesetzt, indem eine Lösung des letzteren mit einer äquimolaren Menge einer Base, z.B. Natriumäthoxid, vermischt wird. Die Umsetzung zwischen dem Acylessigsäureester und dem Amidin wird vorzugsweise in einem Lösungsmittel durchgeführt. Bevorzugte Lösungsmittel sind z.B. Niedrigalkohole, wie Methanol und Äthanol. Das Pyrimidinderivat II, das durch Umsetzung des Acylessigsäureesters mit dem Amidin erhalten worden ist, kann sodann in das 4-Chlorpyrimidin III durch Behandlung mit Phosphoroxychlorid umgewandelt werden. Geeigneterweise wird das Pyrimidinderivat II unter Rückfluß in überschüssigem

Phosphoroxychlorid erhitzt. Die 4-Chlorverbindung, die so erhalten wird, kann durch herkömmliche Methoden isoliert werden, indem beispielsweise das überschüssige Phosphoroxychlorid abdestilliert wird und Eis zugesetzt wird, worauf das zurückbleibende Pyrimidin III durch Umkristallisation aus einem geeigneten Lösungsmittel oder durch Destillation gereinigt wird. Das 4-Chlorpyrimidin kann sodann in das 4-substituierte Derivat IV umgewandelt werden, indem es mit einem Alkalimetallderivat eines Alkohols umgesetzt wird.

Die Reaktion wird zweckmäßigerweise in einem Lösungsmittel für die Reaktionsteilnehmer durchgeführt. Das Lösungsmittel kann z.B. der Alkohol R^3OH sein, aus dem das Metallderivat R^3OM hergestellt wird. Das zur Herstellung des Derivats R^3OM verwendete Metall ist ein Alkalimetall oder Erdalkalimetall, z.B. Natrium, Kalium, Calcium oder Magnesium. Wenn das zu verwendende Lösungsmittel der Alkohol R^3OH ist, dann kann die Herstellung des 4-substituierten Derivats IV geeigneterweise in der Weise durchgeführt werden, daß man das Metall, beispielsweise Natrium, in einer Menge, welche bezüglich der zu verwendenden Menge des 4-Chloropyrimidinderivats mindestens äquimolar ist, in einem Überschuß des Alkohols R^3OH auflöst, hierauf das 4-Chloropyrimidin-derivat zusetzt und dann das Reaktionsgemisch über einen genügenden Zeitraum erhitzt, daß die Reaktion vervollständigt wird. Die Temperatur der Reaktion ist nicht kritisch, doch kann als allgemeine Richtlinie angegeben werden, daß Temperaturen im Bereich von 25 bis 100°C im allgemeinen geeignet sind, während solche von 60 bis 100°C im allgemeinen bevorzugt werden. Das 4-substituierte Pyrimidin kann auch aus dem Reaktionsgemisch durch herkömmliche Methoden isoliert werden, indem beispielsweise das Gemisch in Wasser gegossen wird, das wäßrige Gemisch mit einem organischen Lösungsmittel extrahiert wird und das organische Lösungsmittel abgedampft wird, um das extrahierte Material zu gewinnen. Letzteres kann durch herkömmliche Methoden destilliert oder umkristallisiert werden.

Wenn es bevorzugt wird, keinen Überschuß des Alkohols R^3OH als Lösungsmittel zur Herstellung der 4-substituierten Derivate IV zu verwenden, dann kann die Reaktion in einem aprotischen Lösungsmittel, z.B. einem Kohlenwasserstofflösungsmittel, wie Toluol oder leichtem Petroleum, durchgeführt werden. Andere geeignete Lösungsmittel sind z.B. dipolare aprotische Lösungsmittel, wie Dimethylsulfoxid, und Äther, wie Dioxan.

Die Erfindung wird in den Beispielen erläutert.

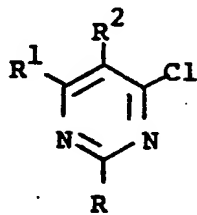
Beispiel 1

Dieses Beispiel beschreibt die Herstellung der Verbindung Nr. 15 der Tabelle I.

4-Chlor-2,6-dimethylpyrimidin (4,28 g) wurde zu einer Lösung von Natrium (0,92 g) in Isobutanol gegeben. Das Gemisch wurde 30 min lang am Rückfluß erhitzt und eingeeengt. Zu dem Rückstand wurde Wasser gegeben. Das Gemisch wurde mit Chloroform extrahiert und die Extrakte wurden getrocknet und eingedampft. Das hellgelbe Öl wurde bei einer Ofentemperatur von $90^{\circ}C$ und einem Druck von 0,1 Torr abdestilliert, wodurch ein klares, farbloses bewegliches Öl mit einem Brechungsindex $n_D^{25} = 1,4757$ erhalten wurde, das als Verbindung Nr. 15 der Tabelle I identifiziert wurde.


Die meisten der in Tabelle I angegebenen Verbindungen wurden nach der Verfahrensweise erhalten, wie sie oben im Zusammenhang mit der Verbindung Nr. 15 angegeben wurde, d.h. durch Umsetzung des entsprechend substituierten 4-Chlorpyrimidins mit einem Metallderivat der entsprechenden Hydroxyverbindung R^3OH . Die Hauptmenge der als Zwischenprodukte erforderlichen substituierten 4-Chlorpyrimidine sind bekannte Verbindungen. Für diejenigen 4-

Chlorpyrimidinderivate, die neu erscheinen, sind nachstehend
die physikalischen Konstanten tabellarisch aufgeführt:



(III)

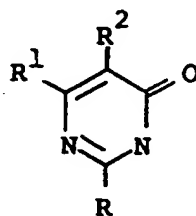
Tabelle II

R	R ¹	R ²	Physikalische Konstante
4-Chlorophenyl	CH ₃	H	Fp. 108-109°C
3-Methoxyphenyl	CH ₃	H	Fp. 61.5-63°C
3-Methylbenzyl	CH ₃	H	Fp. 50-53°C
4-Chlorobenzyl	CH ₃	H	Fp. 70-71.5°C
4-Phenylbenzyl	CH ₃	H	Fp. 66-68°C
4-Methoxybenzyl	CH ₃	H	Fp. 76-78°C
2-Methylbenzyl	CH ₃	H	Fp. 60-64°C
3-CF ₃ -benzyl	CH ₃	H	n _D ²² 1.5188
-CH=CH-Ph	CH ₃	H	Fp. 68-70°C
-CH=CH-C ₆ H ₃ ,4-Cl ₂	CH ₃	H	Fp. 34-36°C
-CH=CH-C ₆ H ₄ -4-CN	CH ₃	H	Fp. 179.5-181°C
-CH=CH- 	CH ₃	H	Fp. 88-90°C

Fortsetzung Tabelle II

-CH=CH-CF ₃	CH ₃	H	¹⁹ _D 1.4750
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	²¹ _D 1.4561
-CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	H	²¹ _D 1.5055
-CH ₂ OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	²² _D 1.4932

Die obigen 4-Chloropyrimidine wurden in der Weise hergestellt, daß die entsprechenden 4-Pyrimidone II mit Phosphoroxychlorid nach Standardverfahrensweisen erhitzt wurden. Für diejenigen 4-Pyrimidonderivate, die als neu erscheinen, sind nachstehend die physikalischen Konstanten tabellarisch aufgeführt.



(II)

- 50 -

Tabelle III

R	R ¹	R ²	Schmelzpunkt °C
-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	138-139
-C ₅ H ₁₁	CH ₃	H	78.5-80
-CH ₂ Ph	CH ₃	H	169-171
3-Methylbenzyl	CH ₃	H	179-182
4-Chlorobenzyl	CH ₃	H	212-215
4-Phenylbenzyl	CH ₃	H	191-195
4-Methoxybenzyl	CH ₃	H	190-192
2-Methylbenzyl	CH ₃	H	185-188
3-CF ₃ -benzyl	CH ₃	H	167-169
-CH=CH-Ph	CH ₃	H	222.5-224.5
-CH=CH-C ₆ H ₃ Cl ₂	CH ₃	H	254.5-256.5
-CH=CH-C ₆ H ₄ -4-CN	CH ₃	H	> 250

709886/0875

Fortsetzung Tabelle III

$-\text{CH}=\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-3-\text{CF}_3$	CH_3	H	230-231
$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CF}_3$	CH_3	H	140.5-143
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$	CH_3	H	172-173
$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	H	82.5-85.5

Eine kleine Anzahl der Verbindungen der Tabelle I wurde nach Verfahren hergestellt, die zu denjenigen hinzukommen, die in dem obigen Schema A beschrieben sind. Die Herstellung dieser Verbindungen und von einigen Zwischenprodukten wird nachstehend beschrieben.

Verbindung Nr. 115

Ein Gemisch aus 2-Benzyl-4-isobutoxy-5-benzylpyrimidin (Verbindung 102 der Tabelle I) (5,0 g) und N-Bromsuccinimid (3,48 g) in trockenem Chloroform (15 ml) wurde 5 h am Rückfluß erhitzt, abgekühlt und mit weiterem Chloroform verdünnt. Das verdünnte Reaktionsgemisch wurde mit verdünnter Natriumcarbonatlösung, sodann mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingedampft. Das zurückbleibende orange-rote Öl wird bei einer Ofentemperatur von 158 bis 160°C und 0,05 Torr destilliert, wodurch ein farbloses viskoses Öl erhalten wurde, das sich langsam verfestigte (Fp 43 bis 45°C).

Verbindung Nr. 116

Propylamin (5 ml) wurde zu einer Lösung der Verbindung Nr. 115 (1,43 g) in Acetonitril (15 ml) gegeben. Die Lösung wurde 2,5 h auf 60°C erhitzt, abgekühlt und in Wasser gegossen. Das Produkt wurde mit Chloroform extrahiert und der Extrakt wurde mit Kochsalzlösung gewaschen, getrocknet und eingedampft, wodurch ein gelbes Öl zurückblieb. Die Destillation bei einer Ofentemperatur von 140 bis 145°C und einem Druck von 0,15 Torr lieferte die Verbindung 116.

Herstellung von 6-Methyl-2-styryl-4-pyrimidon:

2,3-Dimethyl-6-hydroxypyrimidin (30 g) und Benzaldehyd (25,65 g) in Essigsäureanhydrid (70 ml) wurden 8 h lang auf 150°C erhitzt.

Das Gemisch wurde konzentriert, abgekühlt und mit verdünnter wäßriger Natriumbicarbonatlösung verrührt. Der ausgefallene Feststoff wurde gesammelt, gewaschen, getrocknet und aus Chloroform/Petroleum (Kp 30 bis 40°C) umkristallisiert, wodurch das angestrebte 6-Methyl-2-styryl-4-pyrimidon erhalten wurde. Diese Verbindung wurde in die entsprechende 4-Chlorverbindung auf die übliche Weise mit Phosphoroxychlorid umgewandelt. Diese Verbindung wurde sodann als Zwischenprodukt für die Verbindungen 117 und 118 verwendet.

Herstellung von 6-Methyl-4-(2-methylbutoxy)-2,2-(4-cyanophenyl)-äthylpyrimidin (Verbindung Nr. 96):

2-(4-Cyanostyryl)-6-methyl-4-(2-methylbutoxy)-pyrimidin (1,87 g) und p-Toluolsulfonylhydrazid (2,28 g) wurden 2 h lang am Rückfluß in 2-Methoxyäthanol (25 ml), das Äthanolanin (0,19 g) enthielt, erhitzt. Das Gemisch wurde abgekühlt, in Wasser gegossen und mit Dichlormethan extrahiert. Die Extrakte wurden mit Kochsalzlösung gewaschen, getrocknet und eingedampft. Das zurückbleibende Öl wurde durch Durchleiten durch eine Kieselsäuregelsäule in Dichlormethan gereinigt. Das Eindampfen der Dichlormethanolösung lieferte das Produkt (Verbindung Nr. 96) als Öl.

Herstellung von 2-(3,3,3-Trifluorpropenyl)-6-methyl-4-pyrimidon:

Ein Gemisch aus 2,4-Dimethyl-6-hydroxypyrimidin (22,02 g), Trifluoracetaldehydhydrat (20,6 g) und Essigsäureanhydrid (90 ml) wurde 13 h auf 150°C erhitzt. Der größte Teil des Überschusses des Essigsäureanhydrids wurde unter vermindertem Druck entfernt. Der abgekühlte Rückstand wurde mit verdünnter Natriumbicarbonatlösung gerührt. Der abgeschiedene Feststoff wurde gesammelt, getrocknet und mit Äther und sodann mit Petroleum gewaschen, wodurch ein weißes kristallines Produkt erhalten wurde. Dieses wurde in das entsprechende 4-Chlorpyrimidin und sodann in di

Verbindungen 91 und 92 nach der in Schema A b beschriebenen Methode umgewandelt.

Herstellung von 2-(3,3,3-Trifluorpropyl)-6-methyl-4-pyrimidon:

Eine Lösung von 2-(3,3,3-Trifluorpropenyl)-6-methyl-4-pyrimidon (5 g), hergestellt wie oben beschrieben, in Äthanol (80 ml) wurde in einer Wasserstoffatmosphäre mit einem 5% Palladium-auf-Holzkohle-Katalysator (0,2 g) geschüttelt, bis die errechnete Wasserstoffmenge absorbiert worden war. Der Katalysator wurde entfernt und das Filtrat wurde eingedampft, wodurch das Produkt mit einem Schmelzpunkt von 172 bis 173°C erhalten wurde. Dieses Produkt wurde in das entsprechende 4-Chlorpyrimidin und sodann in die Verbindung Nr. 90 nach der in Schema A beschriebenen Methode umgewandelt.

Beispiel 2

Dieses Beispiel beschreibt die Herstellung von 4-Benzoyloxy-2-p-chlorbenzyl-6-methylpyrimidin (Verbindung Nr. 103 der Tabelle I).

a) Herstellung von 4-Chlorphenylacetamidin:

Trockener Chlorwasserstoff wurde durch ein Gemisch aus 4-Chlorbenzylcyanid (50 g), Äthanol (25,1 g) und Cyclohexan (45 ml), das bei 20 bis 30°C gehalten wurde, geleitet, bis dieses gesättigt war (3 h). Durch das Gemisch wurde 1 h lang trockene Luft geleitet, um überschüssigen Chlorwasserstoff zu entfernen. Dieses Gemisch wurde langsam zu Isopropanol (250 ml) gegeben, das mit Ammoniak gesättigt war und bei 20 bis 30°C gehalten wurde. Nach beendigter Zugabe wurde mehr Ammoniak zur Sättigung eingeleitet. Das Gemisch wurde sodann über Nacht bei Raumtemperatur belassen. Das Ammoniumchlorid wurde abfiltriert und das Filtrat wurde zur Trockene eingedampft. Der Rückstand wurde mit eiskaltem Aceton

gewaschen, wodurch 4-Chlorph nylacetamidin-hydrochlorid, Fp 184°C, erhalten wurde.

b) Herstellung von 2-p-Chlorbenzyl-6-methylpyrimid-4-on:

Das oben unter a) erhaltene Amidinhydrochlorid (50,0 g) wurde zu einer Lösung von Natrium (12,35 g) in Äthanol (300 ml) gegeben. Sodann wurde Äthylacetoacetat (34,89 g) zugesetzt. Dieses Gemisch wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt und sodann 2 1/2 h am Rückfluß erhitzt. Das Gemisch wurde zu einem kleinen Volumen eingeeengt und der Rückstand wurde in Wasser aufgelöst, abgekühlt und mit Essigsäure auf einen pH-Wert von 5 bis 6 gebracht. Der ausgefallene Feststoff wurde mit Aceton gewaschen und getrocknet, wodurch das Pyrimidon mit einem Fp von 212 bis 215°C erhalten wurde.

c) Herstellung von 4-Chlor-2-p-chlorbenzyl-6-methylpyrimidin:

Ein Gemisch des oben unter b) erhaltenen Pyrimidons (37,04 g) mit Phosphoroxychlorid (130 ml) wurde 1 h lang am Rückfluß erhitzt. Das Gemisch wurde zu einem kleinen Volumen eingeeengt und der Rückstand wurde abgekühlt und sorgfältig zu Eis und Wasser gegeben. Das Gemisch wurde mit konzentrierten Ammoniak alkalisch gemacht. Das Produkt wurde mit Chloroform extrahiert und die Extrakte wurden mit Kochsalzlösung gewaschen und getrocknet. Die Extrakte ergaben ein Rohprodukt, das in einem Gemisch aus Äther und Petroleum (Kp 30 bis 40°C) aufgelöst wurde. Die Lösung wurde filtriert und das Filtrat wurde eingedampft, wodurch 4-Chlorpyrimidin mit einem Fp von 70 bis 71,5°C erhalten wurde.

d) Herstellung von 4-Benzyl-2-p-chlorbenzyl-6-methylpyrimidin:

Benzylalkohol (2,03 g) wurde zu einer Suspension von Natrium-

hydrid (0,522 g) in Acetonitril (25 ml) gegeben. Nach beendigt r Wasserstofffreisetzung wurde das Chlorpyrimidin (5,0 g) von c) zugesetzt. Das Gemisch wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt und in Wasser gegossen. Das Produkt wurde mit Chloroform extrahiert und der Extrakt wurde mit Kochsalzlösung gewaschen, getrocknet und zu einem Öl eingeeengt. Die Destillation bei 176 bis 180°C und 0,15 Torr lieferte das Produkt als hellgelbes Öl mit einem Brechungsindex n_D^{21} von 1,5876.

Beispiel 3

Dieses Beispiel beschreibt die herbiziden Eigenschaften der bei dem erfindungsgemäßen Verfahren verwendeten Verbindungen. Die jeweilige Verbindung (0,12 g) wurde zum Test formuliert, indem sie mit 5 ml einer Emulsion vermischt wurde, die in der Weise hergestellt worden war, daß 100 ml einer Lösung, die 21,8 g pro l Span 80 und 78,2 g pro l Tween 20 in Methylcyclohexanon enthielt, mit Wasser auf 500 ml verdünnt wurde. Span 80 ist das Warenzeichen für ein oberflächenaktives Mittel aus Sorbitmonolaurat. Tween 20 ist das Warenzeichen für ein oberflächenaktives Mittel, das ein Kondensat aus 20 molaren Verhältnismengen Äthylenoxid mit Sorbitmonooleat darstellt. Das Gemisch aus der Verbindung und der Emulsion wurde mit Glasperlen geschüttelt und mit Wasser auf 12 ml verdünnt.

Die Spritzzusammensetzung, die auf diese Weise hergestellt worden war, wurde auf junge Topfpflanzen (Nachlaufstest) der in Tabelle II angegebenen Pflanzenarten mit einer Menge aufgespritzt, die 1000 l pro ha (10 kg Pyrimidinverbindung pro ha) äquivalent war. Die Beschädigung der Pflanzen wurde 14 Tage nach dem Spritzen durch Vergleich mit unbehandelten Pflanzen bewertet. Es wurde eine Skala von 0 bis 3 angewendet, in der 0 keinen Effekt bis zu einer 25%igen Schädigung und 3 ein 75- bis 100%iges Abtöten bedeutet. Bei einem Test für die herbizide Vorlaufaktivität wur-

den Samen der Testpflanzen auf die Oberfläche von Fasertrögen von Erde gebracht und sie wurden mit den Zusammensetzungen mit einer Menge von 1000 l pro ha gespritzt. Die Samen wurden sodann mit weiterer Erde bedeckt. 14 Tage nach dem Spritzen wurden die Sämlinge in den gespritzten Fasertrögen mit den Sämlingen in ungespritzten Kontrolltrögen verglichen. Die Schäden wurden anhand der gleichen Skala mit 0 bis 3 bewertet. Die erhaltenen Ergebnisse sind in Tabelle IV zusammengestellt:

Tabelle IV

Verbindung Nr.	*Vor- oder Nach- laufaufbringung	Testpflanzen					
		Lt	To	Wo/O	Ll	Cn	St
1	B	-	1	0	0	0	0
	A	3	0	0	0	0	3
2	B	1	0	0	0	0	0
	A	0	0	-	0	0	3
3	B	2	1	0	0	0	1
	A	1	2	0	0	0	3
4	B	0	0	0	0	0	0
	A	3	1	0	1	0	3
5	B	0	0	0	0	0	0
	A	0	0	0	3	0	-
6	B	0	0	0	0	0	0
	A	1	1	0	0	0	3
7	B	0	0	0	0	0	0
	A	1	0	0	0	0	1
8	B	3	3	2	2	0	1
	A	3	2	0	0	0	3
9	B	1	2	0	0	0	-
	A	0	0	1	0	0	-
10	B	3	3	3	3	0	3
	A	0	0	0	0	0	

Fortsetzung Tabell IV

11	B	3	3	2	2	0	2
	A	0	0	0	0	0	0
12	B	3	3	3	3	0	2
	A	0	0	0	0	0	3
13	B	-	3	3	3	0	3
	A	1	0	0	0	0	0
14	B	-	3	3	3	0	3
	A	0	0	-	0	0	0
15	B	3	3	3	3	0	3
	A	1	2	1	0	0	-
16	B	3	3	3	3	0	3
	A	1	1	1	1	0	2
17	B	1	0	0	3	0	0
	A	1	0	0	0	0	2
20	B	3	3	2	3	0	3
	A	0	0	0	0	0	3
22	B	3	3	2	3	0	3
	A	0	0	0	0	0	0
27	B	2	3	3	3	0	3
	A	0	0	0	0	0	0

45

2734827

Forts tzung Tabelle IV

33	B	0	0	0	0	0	0
	A	3	2	0	0	-	2
34	B	3	3	2	3	0	1
	A	3	2	0	2	1	2
36	B	3	3	3	3	0	2
	A	3	2	1	2	0	3
37	B	-	-	-	-	-	-
	A	1	0	2	0	0	3
39	B	3	1	0	1	0	2
	A	3	3	2	2	0	3
40	B	0	0	0	0	0	0
	A	1	2	0	0	0	2
42	B	3	2	0	3	0	3
	A	3	3	2	2	0	3
43	B	0	0	0	0	0	0
	A	3	1	0	0	0	1
44	B	1	3	0	0	0	1
	A	0	-	0	0	0	3
46	B	1	2	0	0	0	0
	A	0	0	0	0	0	3

709886/0875

Fortsetzung Tabelle IV

47	B	0	0	2	3	0	0
	A	3	2	0	1	0	3
48	B	0	0	0	3	0	-
	A	3	1	1	1	0	3
49	B	3	3	3	3	0	3
	A	0	0	0	2	0	3
64	B	1	3	2	3	0	3
	A	1	2	1	3	0	3
65	B	0	3	0	1	0	0
	A	0	0	0	0	0	1
66	B	-	0	-	0	0	0
	A	0	1	0	0	0	1
67	B	-	3	-	1	0	2
	A	1	1	0	1	0	1
68	B	3	3	3	3	0	3
	A	0	0	0	0	0	2
70	B	3	3	3	3	0	3
	A	0	1	1	1	1	2
71	B	2	3	2	3	0	2
	A	1	3	1	2	1	2

- 42 -
42

2734827

Fortsetzung Tabelle IV

74	B	2	3	0	2	0	2
	A	0	2	0	1	0	1
75	B	3	3	2	2	0	3
	A	2	2	0	0	0	2
76	B	2	3	3	2	0	1
	A	2	1	0	1	0	2
77	B	0	0	0	1	0	0
	A	0	1	1	1	0	2
78	B	1	1	1	3	0	1
	A	2	2	0	2	0	2
79	B	3	3	3	3	0	2
	A	1	2	0	1	0	3
80	B	3	3	2	3	0	3
	A	3	3	2	3	1	3
81	B	1	3	0	1	0	3
	A	1	2	1	0	0	2
82	B	3	3	3	3	0	3
	A	1	0	0	2	0	3
83	B	3	3	2	2	0	3
	A	1	1	1	2	0	3

709886/0875

Fortsetzung Tabelle IV

84	B	0	0	0	1	0	0
	A	0	0	0	0	0	1
85	B	0	0	0	0	0	0
	A	2	0	0	0	0	1
86	B	2	3	2	3	0	3
	A	3	0	0	0	0	0
87	B	-	1	3	3	0	1
	A	2	0	0	0	0	1
88	B	0	0	3	3	0	3
	A	2	0	0	0	0	1
89	B	0	2	0	1	0	0
	A	3	0	0	0	0	2
91	B	2	0	0	0	0	0
	A	1	2	1	1	0	1
92	B	0	0	0	0	0	0
	A	0	1	0	0	0	1
93	B	1	1	0	1	0	1
	A	0	2	0	2	0	2
94	B	2	3	3	3	0	3
	A	2	2	1	3	0	3

- 44 -
49

2734827

Fortsetzung Tabelle IV

95	B	0	0	0	0	0	0
	A	0	1	0	0	0	1
96	B	0	0	0	0	0	0
	A	1	1	0	1	0	1
97	B	0	0	0	0	0	0
	A	0	1	1	0	0	1
98	B	0	0	0	0	0	0
	A	0	1	0	0	0	1
99	B	0	0	0	0	0	0
	A	1	1	0	0	0	3
100	B	3	1	2	2	0	2
	A	3	3	1	2	0	3
101	B	3	3	3	3	0	2
	A	1	1	0	1	0	2
107	B	3	3	3	3	0	3
	A	3	3	2	3	2	3
108	B	0	0	0	3	0	0
	A	1	2	2	3	2	3
109	B	3	0	0	3	0	0
	A	3	2	0	2	-	2

709886/0875

Fortsetzung Tabelle IV

110	B	3	3	1	2	0	1
	A	2	2	0	0	0	3
111	B	3	3	3	3	0	3
	A	3	3	1	3	1	3
112	B	3	3	1	3	0	3
	A	1	2	0	2	-	1
113	B	3	3	3	3	0	2
	A	1	2	0	2	1	3
114	B	3	1	1	3	3	0
	A	0	0	0	2	0	0
115	B	3	3	3	3	3	3
	A	2	2	1	2	0	2
116	B	3	3	3	3	0	3
	A	2	2	0	1	-	2

* In der Tabelle bedeutet B eine Vorlaufaufbringung und A eine Nachlaufaufbringung.

Die Namen der Testpflanzen sind wie folgt:

Lt Kopfsalat
To Tomaten

WO/O	wilder Hafer und kultivierter Hafer. Wilder Hafer (<i>Avena fatua</i>) wird beim Nachlauf-test verwendet. Beim Vorlauf-test wird kultivierter Hafer verwendet.
Ll	<i>Lolium perenne</i> (Weidelgras)
Cn	<i>Cyperus rotundus</i>
St	<i>Setaria viridis</i> .

Beispiel 4

Dieses Beispiel beschreibt die herbiziden Eigenschaften von Verbindungen, die gemäß der Erfindung verwendet werden. Jede Verbindung wurde zum Test in der Weise formuliert, daß eine entsprechende Menge mit 5 ml einer Emulsion vermischt wurde, die in der Weise hergestellt worden war, daß 160 ml einer Lösung, enthaltend 21,8 g pro 1 Span 80 und 78,2 g pro 1 Tween 20, in Methylcyclohexanon mit Wasser auf 500 ml verdünnt wurde. Die 5 ml der Emulsion, die die Testverbindung enthielten, wurden sodann mit Wasser auf 40 ml verdünnt und auf den in Tabelle V angegebenen Bereich der Testpflanzen aufgespritzt.

Es wurde ebenfalls ein wie im Beispiel 3 beschriebener Vorlauf-test durchgeführt. Die Pflanzen wurden beim Nachlauf-test 2 Wochen nach der Behandlung und beim Vorlauf-test 3 Wochen nach der Behandlung beobachtet. Die Beschädigung der Pflanzen wurde anhand einer Skala von 0 bis 5 bewertet, wobei 0 eine 0- bis 20%ige Beschädigung und 5 eine vollständige Abtötung bedeuten. Die Ergebnisse sind in Tabelle V zusammengestellt:

Tabelle V

		Testpflanzen																										
1	2	3	Sb	Rp	Ct	Sy	Mz	Ww	Rc	Sn	Ip	Am	Pi	Ca	Po	Xs	Ab	Cv	Ot	Dg	Pu	St	Ec	Sh	Ag	Cn		
1	B	5	0	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	3	0	0	0	-	0	1	-	1	0	1	0	0		
	A		1	1	0	2	0	1	0	0	1	3	0	2	3	0	4	0	1	5	1	5	5	5	0	0		
10	B	5	0	3	3	4	0	2	0	0	1	1	0	1	2	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0		
11	B	5	0	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0	2	0	0	0	-	0	0	0	0	1	0	0	0		
13	B	5	1	1	0	0	1	4	5	0	2	2	0	0	1	0	3	-	4	3	3	1	4	4	0	0		
14	B	5	0	4	0	2	4	4	4	2	0	4	0	3	5	0	4	-	4	5	4	5	4	4	4	0		
15	B	5	1	4	0	3	0	3	1	0	3	0	0	0	2	0	4	-	1	1	0	1	4	0	0	-		
	A		1	1	0	2	1	0	0	0	1	3	0	1	1	0	0	0	1	4	2	1	-	0	0	0		
16	B	5	0	4	1	3	0	3	3	5	0	5	-	3	5	0	5	-	4	-	5	5	5	0	0	0		
18	B	5	4	5	0	3	3	4	4	0	4	5	0	4	5	0	5	-	5	5	5	5	5	4	3	0		
	A		1	0	0	1	0	0	0	0	3	1	2	1	0	0	0	1	1	3	0	0	0	0	0	0		

709886/0875

Fortsetzung Tabelle V

1	2	3	Sb	Rp	Ct	Sy	Mz	Ww	Rq	Sn	Ip	Am	Pi	Ca	Po	Xs	Ab	Cv	Ot	Dg	Pu	St	Ec	Sh	Ag	Cn
19	B	5	3	4	0	0	0	0	2	3	0	4	1	4	5	0	4	-	2	5	4	5	4	3	2	0
21	B	5	4	0	0	0	4	4	4	0	3	2	-	4	4	0	0	-	4	4	2	1	4	2	0	0
A			1	1	1	1	4	1	0	0	0	0	0	-	1	0	1	1	0	3	1	4	2	0	0	0
22	B	5	0	2	1	2	0	0	0	2	3	0	0	0	0	0	1	-	0	0	0	0	2	2	0	0
23	B	5	4	4	0	1	0	1	3	1	0	2	0	0	4	0	3	-	4	4	3	4	4	4	0	0
24	B	5	2	4	1	4	4	4	4	3	5	2	3	1	5	0	4	-	4	4	4	4	4	5	4	0
25	B	5	4	4	2	4	3	4	4	2	5	4	0	3	4	0	4	-	5	5	5	5	5	5	2	0
26	B	5	4	4	1	4	3	3	4	3	4	1	0	0	4	0	3	-	3	4	4	4	4	4	0	0
28	B	5	4	4	2	3	2	4	4	4	4	4	0	4	5	0	4	-	4	5	5	5	4	5	4	0
A			2	1	2	3	4	1	1	2	2	3	1	3	3	0	2	1	2	4	3	4	3	4	1	1
29	B	5	3	5	0	3	3	4	4	0	4	4	0	3	5	0	4	-	4	4	4	5	5	5	4	0
A			1	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	3	3	0	1	0	1	3	1	2	0	0	0	0

709886/0875

Fortsetzung Tabelle V

1	2	3	Sb	Rp	Ct	Sy	Mz	Ww	Rc	Sn	Ip	Am	Pi	Ca	Po	Xs	Ab	Cv	Ot	Dg	Pu	St	Ec	Sh	Ag	Cn
30	B	5	0	0	0	0	0	0	0	-	0	4	2	1	0	0	3	-	1	3	3	3	4	4	0	0
	A		1	2	1	3	2	0	0	0	2	-	1	3	3	0	1	4	0	2	3	1	0	0	0	0
31	B	5	2	4	0	2	2	4	4	0	2	4	3	4	5	1	4	-	4	5	5	5	4	4	4	0
	A		1	3	0	1	0	0	0	0	2	1	0	4	4	1	3	3	1	3	3	3	3	0	0	0
32	B	5	0	2	0	0	0	2	1	4	0	2	-	4	5	0	4	-	3	-	5	5	5	1	1	0
	A		3	3	1	4	2	1	1	1	3	3	1	4	3	2	4	4	2	4	3	3	2	1	0	1
35	B	5	5	5	2	4	3	4	4	-	4	5	4	4	4	0	5	-	5	5	5	5	5	5	5	0
	A		2	1	1	3	2	0	0	0	1	-	0	4	4	0	1	2	0	4	4	0	1	3	0	0
38	B	5	1	0	0	0	0	0	0	3	0	3	-	3	3	0	2	-	0	4	4	2	0	4	0	0
	A		4	2	1	1	2	0	1	1	3	2	1	-	4	3	4	3	1	5	2	4	3	0	0	0

709886/0875

54

2734827

- 92 -

Fortsetzung Tabelle V

1	2	3	Sb	Rp	Ct	Sy	Mz	Ww	Rc	Sn	Ip	Am	Pi	Ca	Po	Xs	Ab	Cv	Ot	Dg	Pu	St	Ec	Sh	Ag	Cn
41	B	5	0	3	1	0	0	0	0	-	0	4	4	1	4	0	5	-	0	2	1	1	3	1	0	0
	A		2	1	0	3	0	1	0	0	2	-	0	3	4	0	1	2	0	1	2	0	0	0	0	0
42	B	5	2	1	0	0	0	0	0	1	0	0	0	1	0	-	0	-	0	4	4	3	1	3	0	0
	A		2	3	2	2	3	1	1	1	2	2	1	4	2	-	3	2	1	3	3	4	2	2	1	0
45	B	5	0	1	1	0	0	0	0	0	3	0	-	0	4	0	0	-	0	4	3	4	4	4	0	0
	A		1	1	0	0	1	0	0	0	0	2	1	1	1	1	1	1	1	0	2	3	2	0	0	0
50	B	5	5	5	4	4	4	4	4	-	4	5	4	4	5	1	4	-	5	5	5	5	5	5	4	0
	A		0	-	0	1	2	1	0	0	0	1	1	0	0	0	0	0	1	4	2	4	4	0	0	0
51	B	1	2	2	1	2	3	3	1	-	2	5	0	4	5	0	4	-	3	5	5	5	5	5	3	0
	A		2	-	2	2	2	0	1	0	1	0	0	0	3	1	3	1	2	4	3	4	4	1	0	0

Fortsetzung Tabelle V

1	2	3	Sb	Rp	Ct	Sy	Mz	Ww	Rc	Sn	Ip	Am	Pi	Ca	Po	Xs	Ab	Cv	Ot	Dg	Pu	St	Ec	Sh	Ag	Cn
52	B	1	0	1	0	0	0	3	2	5	0	4	0	0	4	0	4	-	1	4	4	4	5	4	1	0
	A		0	-	0	1	2	0	0	0	0	1	2	0	3	0	2	0	1	3	3	3	4	0	0	0
53	B	5	2	3	0	3	1	1	4	-	2	5	4	4	5	0	4	-	4	5	5	5	5	5	3	0
	-A		4	-	3	4	4	1	1	1	1	4	3	4	4	1	4	4	4	4	4	4	4	1	0	0
54	B	5	4	2	0	0	0	1	2	4	1	4	-	4	5	0	4	-	2	5	5	5	5	5	4	0
	A		4	4	2	2	5	1	1	2	1	1	2	-	4	0	4	2	3	5	4	4	4	2	1	0
55	B	5	4	4	1	3	3	3	3	-	3	3	2	1	4	0	5	-	4	3	1	2	5	2	0	0
	A		0	1	0	0	1	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
56	B	1	0	4	1	0	0	1	1	-	1	2	1	0	4	0	1	-	3	3	1	2	4	2	0	0
	A		0	2	0	0	1	0	0	0	0	1	0	0	0	0	0	0	0	1	0	1	1	-	0	0

709886/0875

- 57 -

Fortsetzung Tabelle V

1	2	3	Sb	Rp	Ct	Sy	Mz	Nw	Rc	Sn	Ip	Am	P1	Ca	Po	Xs	Ab	Cv	Ot	Dg	Pu	St	Ec	Sh	Ay	Cn
57	B	5	4	4	2	4	3	4	4	-	5	4	3	3	5	0	5	-	5	5	5	4	5	5	1	0
	A		0	0	0	0	2	1	1	0	1	-	0	0	0	0	1	0	0	1	3	1	0	0	0	0
58	B	5	5	5	1	4	4	4	4	-	4	5	4	4	5	0	4	-	5	5	5	5	5	5	4	0
	A		1	1	1	2	3	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	3	2	0	0	1	0	0
59	B	5	4	5	2	4	4	4	4	-	4	5	3	4	5	0	5	-	5	5	5	5	5	5	4	0
	A		0	1	0	2	3	0	1	0	1	-	0	0	1	0	1	0	0	4	4	1	1	1	0	0
60	B	1	4	4	1	3	2	2	4	-	2	4	2	1	4	0	3	-	3	5	4	4	5	4	0	0
61	B	5	5	5	2	4	4	4	4	-	4	5	3	4	5	0	5	-	5	5	5	5	5	5	4	0
	A		0	0	1	2	3	1	0	0	1	-	0	1	2	0	1	0	1	4	4	1	3	3	0	0
62	B	5	4	2	4	4	1	4	4	5	4	5	-	5	4	0	3	-	4	-	5	5	5	5	4	0
	A		3	3	4	4	4	2	2	2	4	4	1	4	4	2	4	3	3	4	4	4	4	4	1	

57

2734827

709886/0875

- 53 -

Fortsetzung Tabelle V

1	2	3	Sb	Rp	Ct	Sy	Mz	Ww	Rc	Sn	Ip	Am	Pi	Ca	Po	Xs	Ab	Cv	Ot	Dg	Pu	St	Ec	Sh	Ag	Cn
63	B	5	4	4	5	4	1	4	4	5	4	5	-	3	5	0	4	-	4	-	5	5	5	5	4	0
	A		4	4	2	4	4	3	2	1	3	3	2	4	4	1	4	2	4	4	4	4	4	4	4	3
64	B	5	0	2	0	3	3	3	3	0	0	3	-	1	4	0	3	-	4	-	4	3	4	3	0	0
67	B	5	0	2	0	0	0	2	1	1	0	0	0	0	4	0	2	-	1	4	3	4	4	1	0	0
69	B	5	4	3	0	4	3	0	2	0	4	1	0	1	5	1	4	-	2	5	5	5	5	5	3	0
	A		1	1	0	1	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	0	0	1	5	1	5	4	2	0	0
72	B	5	1	2	0	0	1	2	1	0	1	0	0	0	4	0	4	-	2	4	1	5	4	4	0	0
	A		3	-	1	2	2	0	0	0	1	1	3	1	4	0	3	3	0	4	1	3	4	0	0	0
73	B	5	1	1	0	0	0	0	0	0	2	2	0	0	5	2	2	-	1	5	4	5	5	5	1	0
	A		3	-	1	2	2	0	0	0	2	1	3	4	3	1	4	2	1	4	3	3	3	1	0	0
86	B	5	0	0	0	0	0	0	0	1	0	2	4	0	4	0	0	-	1	0	0	0	0	0	0	0

Fortsetzung Tabelle V

1	2	3	Sb	Rp	Ct	Sy	Mz	Ww	Rc	Sn	Ip	Am	Pi	Ca	Po	Xs	Ab	Cv	Ot	Dg	Pu	St	Ec	Sh	Ag	Cn
90	B	5	1	1	0	0	0	0	3	0	4	-	1	4	0	2	-	1	-	4	4	3	1	0	0	
101	B	5	4	5	1	3	3	2	3	-	4	4	4	4	5	4	5	-	4	5	5	4	5	5	1	0
	A		0	1	1	3	1	0	0	0	1	-	1	2	1	0	0	1	0	4	3	1	0	0	0	0
102	B	5	5	5	2	4	3	3	4	-	4	4	4	4	4	2	4	-	5	5	5	5	5	5	3	0
	A		1	3	2	3	2	0	1	0	2	-	2	3	2	0	1	3	0	4	4	1	0	0	0	0
103	B	5	4	3	1	2	2	3	2	4	1	5	0	4	5	0	4	-	3	5	5	5	5	5	4	0
	A		1	4	2	2	2	1	0	2	2	3	1	4	4	1	-	3	1	4	4	4	4	4	0	0
104	B	5	0	3	1	2	1	3	3	1	1	4	0	4	4	0	2	-	3	4	5	5	5	4	3	0
	A		1	4	3	3	2	0	1	1	1	2	1	4	4	1	-	3	1	4	4	3	3	3	0	0

Fortsetzung Tabelle V

1	2	3	Sb	Rp	Ct	Sy	Mz	Ww	Rc	Sn	Ip	Am	Pi	Ca	Po	Xs	Ab	Cv	Ot	Dg	Pu	St	Ec	Sh	Ag	Cn
105	B	5	0	2	5	1	2	3	3	1	1	4	0	3	4	0	1	-	3	5	5	5	4	5	1	0
	A		2	3	1	2	1	1	0	0	1	1	1	4	4	1	-	2	1	4	4	3	2	2	0	0
115	B	1	0	4	0	0	0	0	1	0	2	0	-	2	4	0	2	-	1	-	4	4	4	0	0	0

Die Überschriften der Tabelle V haben folgende Bedeutungen:

- 1 gibt die Nr. der Verbindung an
- 2 gibt an, ob es sich um eine Vorlauf- (B) oder Nachlauf- (A) Anwendung handelt
- 3 gibt die Aufbringungsrate in kg/ha an.

Die Namen der Testpflanz n sind wie folgt:

Sp	Zuckerrüben
Rp	Raps
Ct	Baumwolle
Sy	Sojabohnen
Mz	Mais
Ww	Winterweizen
Rc	Reis
Sn	Senecio vulgaris
Ip	Ipomoea purpurea
Am	Amaranthus retroflexus
Pi	Polygonum aviculare
Ca	Chenopodium album
Po	Portulaca oleracea
Ab	Abutilon theophrastii
Cv	Convolvulus arvensis
Ot/Av	wie im Beispiel 3
Dg	Digitaria sanguinalis
Pu	Poa annua
St	Setaria viridis
Ec	Echinochloa crus-galli
Sh	Sorghum halepense
Ag	Agropyron repens
Cn	Cyperus rotundus

Beispiel 5

Dieses Beispiel beschreibt die selektive herbizide Wirkung von Verbindungen, die bei dem erfindungsgemäßen Verfahren verwendet werden. Die Verbindungen wurden, wie im Beispiel 4 beschrieben, für den Test formuliert. Tests wurden mit Gewächshauspflanzen, wie im Beispiel 4 beschrieben, durchgeführt, mit der Ausnahme, daß das Vorgehen beim Vorlauftest etwas unterschiedlich war. Bei

diesem Test wurden die Samen in einen flachen Schlitz in der Erde eingesät. Sodann wurde die Oberfläche eingeebnet und gespritzt. Frische Erde wurde sodann dünn über der gespritzten Oberfläche ausgebreitet. Die Ergebnisse des Nachlauftests wurden nach 2 Wochen und diejenigen des Vorlauftests nach 4 Wochen anhand einer Skala von 0 bis 9 bewertet. In dieser Skala bedeutet 0 eine 0-bis 10%ige Beschädigung und 9 ein 90- bis 100%iges Absterben der Pflanzen. Die Ergebnisse sind in den Tabellen VI, VII und VIII zusammengestellt.

- 56 -

Tabelle VI

Verbindung Nr.	Aufbringungs- rate kg/ha	Vorlauf- (B) oder Nach- lauf- (A) Aufbringung	Testpflanzen															
			Ww	Br	Pe	Rp	Sb	It	Av	Al	Bt	Ag	Sm	Ca	P1	Ma	Sp	
28	1.0	B	1	1	0	3	5	6	8	9	6	3	9	8	3	5	3	
		A	0	0	0	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	1	5	
31	1.0	B	0	0	1	3	3	2	9	9	2	0	9	9	4	3	1	
102	1.0	B	1	1	0	6	8	3	9	9	6	2	9	8	7	-	5	

63

2734827

709886/0875

Di Namen der Testpflanzen sind wie folgt:

Wv	Weizen
Br	Gerste
Pe	Erbsen
Rp	Raps
Sb	Zuckerrüben
Lt	Kopfsalat
Av	Avena fatua
Al	Alopecurus myosuroides
Bt	Bromus tectorum
Ag	Agropyron repens
Sm	Stellaria media
Ca	Chenopodium album
Pi	Polygonum aviculare
Ma	Matricaria inodora
Sp	Sinapis alba

- 88 -

Tabelle VII

Verbin- dung Nr.	Aufbringungs- rate kg/ha	Vorlauf- (B) oder Nach- lauf- (A) Aufbringungs	Testpflanzen															
			Mz	Sy	Gn	Ct	To	Po	Am	Ip	Dt	Ab	Se	Co	Si	Ds	Xa	
28	1.0	B	3	0	0	0	7	9	8	4	8	5	7	3	8	3	2	
		A	1	2	1	0	2	4	2	2	5	2	1	1	1	0	0	
31	1.0	B	0	0	0	0	7	8	8	2	5	3	2	2	5	5	-	

65

2734827

709886/0875

Die Namen der Testpflanzen sind wie folgt:

Mz	Mais
Sy	Sojabohnen
Gn	Erdnuß
Ct	Baumwolle
To	Tomaten
Po	Portulaca oleracea
Am	Amaranthus retroflexus
Ip	Ipomoea purpurea
Dt	Desmodium tortuosum
Ab	Abutilon theophrasti
Se	Sesbania exaltata
Co	Cassia obtusifolia
Si	Sida spinosa
Ds	Digitaria sanguinalis
Xa	Xanthium pensylvanicum

- 52 -

Tabelle VIII

Verbin- dung Nr.	Aufbringungs- rate kg/ha	Verlauf- (B) oder Nach- lauf- (A) Aufbringung	Testpflanzen												
			Sy	Ct	Mz	Rc	Sg	E1	Ec	Dg	St	Sf	Sh	Pm	Cn Nm
28	1.0	B	0	0	2	2	9	9	9	9	9	9	9	9	8
		A	2	1	2	0	3	8	5	9	5	6	3	2	2
31	1.0	B	0	0	1	0	0	9	9	9	9	9	5	9	6

67

2734827

709886/0875

Die Namen der bislang noch nicht genannten Testpflanzen sind wie folgt:

Rc	Reis
Sg	Sorghum
Ei	Eleusine indica
Ec	Echinochloa crus-galli
Dg	Digitaria sanguinalis
St	Setaria viridis
Sf	Setaria faberii
Sh	Sorghum halepense
Pm	Panicum maximum
Cn	Cyperus rotundus

Beispiel 6

Dieses Beispiel beschreibt die selektive herbizide Wirkung von erfindungsgemäß verwendeten Verbindungen bei Reis. Es wurde ein Test durchgeführt, bei dem die Verbindungen auf Gewächshausreis-pflanzen und Unkräutern aufgebracht wurden, die unter simulierten gefluteten Bedingungen der Reiszucht gezüchtet wurden. 26 Tage nach der Behandlung wurden die Beschädigungen der Pflanzen anhand der in den vorstehenden Beispielen verwendeten Skala von 0 bis 9 bewertet. Die Ergebnisse sind in Tabelle IX zusammengestellt. Es wird ersichtlich, daß bei den angewendeten Aufbringungs-raten Reis praktisch nicht beschädigt wird, während die Unkräuter stark beschädigt werden.

Tabelle IX

Verbin- dung Nr.	Aufbringungs- rate kg/ha	Reife		Unkrauter					
		umgepflanzt	gesamt	Ec	Lp	Cd	Mv	Sv	
28	1.0	0 0		7	7	9	7	-	
31	1.0	0 0		7	9	9	-	8	
102	2.0		0 0	8	-	9	-	-	

Die Namen der Testpflanzen sind wie folgt:

Ec	Echinochloa crus-galli
Lp	Leptochloa dubia
Cd	Cyperus difformis
Mv	Monochoria vaginalis
Sv	Salvinia auriculata